

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関
国際事務局



(43)国際公開日
2005年6月16日 (16.06.2005)

PCT

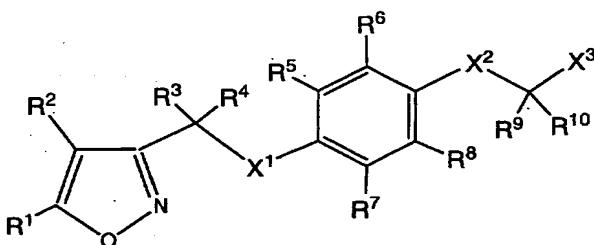
(10)国際公開番号
WO 2005/054213 A1

- (51)国際特許分類⁷: C07D 261/08, 261/20, 261/18, 413/04, 417/12, A61K 31/42, 31/5377, 31/423, 31/5395, 31/4245, 31/5377, 31/502, 31/536, 31/435, 31/428, 31/427, 31/4427, 31/501, 31/506, A61P 43/00, 3/06, 3/10, 3/04, 9/10, 9/12, 29/00, 37/08, 1/04, 19/02, 1/18, 17/06, 17/04, 19/10, 15/00, 35/00, 25/28, 25/16
- (21)国際出願番号: PCT/JP2004/017706
- (22)国際出願日: 2004年11月29日 (29.11.2004)
- (25)国際出願の言語: 日本語
- (26)国際公開の言語: 日本語
- (30)優先権データ:
特願2003-403274 2003年12月2日 (02.12.2003) JP
特願2004-121635 2004年4月16日 (16.04.2004) JP
特願2004-167941 2004年6月7日 (07.06.2004) JP
特願2004-316251 2004年10月29日 (29.10.2004) JP
- (71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka (JP).
- (72)発明者; および
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 福井喜一 (FUKUI, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 笹谷隆司 (SASATANI, Takashi) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 松村謙一 (MATSUMURA, Ken-ichi) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 石塚夏樹 (ISHIZUKA, Natsuki) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 矢野利定 (YANO, Toshisada) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 長命信雄 (CHOMEI, Nobuo) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 神田泰彦 (KANDA, Yasuhiko) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 長命信雄 (CHOMEI, Nobuo) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).
- (74)代理人: 山内秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

[続葉有]

(54)Title: ISOXAZOLE DERIVATIVE HAVING AGONISTIC ACTIVITY AGAINST PEROXISOME PROLIFERATOR-ACTIVATED RECEPTOR

(54)発明の名称: ペルオキシソーム増殖活性化受容体アゴニスト活性を有するイソキサゾール誘導体



(57)Abstract: Compounds represented by the formula (I):[wherein R¹ to R¹⁰ each independently is hydrogen, halogeno, optionally substituted lower alkyl, etc.; X¹ is -O-, -S-, -NR¹¹- (wherein R¹¹ is hydrogen, lower alkyl, etc.), -CR¹²R¹³CO-, -(CR¹²R¹³)_mO-, or -O(CR¹²R¹³)_m- (wherein R¹² and R¹³ each independently is hydrogen or lower alkyl and m is an integer of 1 to 3), etc.; X² is a single bond, -O-, -S-, -NR¹⁴- (wherein R¹⁴ is hydrogen, lower alkyl, etc., provided that R¹⁴ may be bonded to R⁶ to form a ring in cooperation with the adjacent atoms), or -CR¹⁵R¹⁶- (wherein R¹⁵ and R¹⁶ each independently is hydrogen or lower alkyl, provided that R¹⁵ may be bonded to R⁶ or R¹⁰ to form a ring in cooperation with the adjacent carbon atoms and R¹⁶ and R⁹ in combination may form a bond); and X³ is COOR¹⁷, C(=NR¹⁷)NR¹⁸OR¹⁹, etc.], pharmaceutically acceptable salts of the compounds, or solvates of any of these.

WO 2005/054213 A1
provided that R¹⁴ may be bonded to R⁶ to form a ring in cooperation with the adjacent atoms), or -CR¹⁵R¹⁶- (wherein R¹⁵ and R¹⁶ each independently is hydrogen or lower alkyl, provided that R¹⁵ may be bonded to R⁶ or R¹⁰ to form a ring in cooperation with the adjacent carbon atoms and R¹⁶ and R⁹ in combination may form a bond); and X³ is COOR¹⁷, C(=NR¹⁷)NR¹⁸OR¹⁹, etc.], pharmaceutically acceptable salts of the compounds, or solvates of any of these.

(57)要約: 式(I):【化1】(式中、R¹~R¹⁰は各々独立して水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル等であり、X¹は-O-、-S-、-NR¹¹- (ここでR¹¹は水素または低級アルキル等)、-CR¹²R¹³CO-、-(CR¹²R¹³)_mO-または-O(CR¹²R¹³)_m- (ここでR¹²およびR¹³は各々独立して水素または低級アルキルであり、mは1~3の整数)等であり、X²は単結合、-O-、-S-、-NR¹⁴- (ここでR¹⁴は水素または低級アルキル等、R¹⁴はR⁶と共に隣接する原子と一緒にになって環を形成してもよい)または-CR¹⁵R¹⁶- (ここでR¹⁵およびR¹⁶は各々独立して水素または低級アルキルであり、R¹⁵はR⁶またはR¹⁰と共に隣接する炭素原子と一緒にになって環を形成してもよく、R¹⁶はR⁹と一緒にになって結合を形成してもよい)であり、X³はCOOR¹⁷またはC(=NR¹⁷)NR¹⁸OR¹⁹等である)で示される化合物、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。



- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY,

KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。